

# Patent Plaques

Recognize  
the achievement

## JP55038359A2: PREPARATION OF (3-BENZOYLPHENYL)-PROPIONIC ACID

[View images \(1 pages\)](#) | [View INPADOC only](#)

Country

JP Japan

Kind

Inventor(s)

SONODA TSUNEKAZU  
UEYAMA TAMIO

Applicant(s)

HAMARI YAKUHHN KOGYO KK  
[News, Profiles, Stocks and More about this company](#)

Issued/Filed Dates

March 17, 1980 / Sept. 12, 1978

Application Number

JP1978000112737

IPC Class

C07C 59/84; C07C 51/16;

Abstract

**Purpose:** The condensation reaction between a specific thiazolidine derivative and 3-benzylacetophenone is followed by hydrolysis, desulfurization and decarboxylation to give title compound useful as anti-inflammatory, analgesic, antipyretic, etc., with industrial advantage.

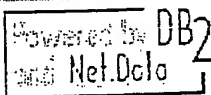
**Constitution:** The dehydrative condensation reaction of (A)-2-thioxo-4-oxothiazolidine of formula I with 3-benzylacetophenone is effected under heating to form 2-thioxo-4-oxo-5-[1-(3-benzylphenyl)-ethyliene]thiazolidine. The hydrolysis of the product gives 2-thioxo-(3-benzylphenyl)-butanoic acid of formula III, which is desulfurized into 2-oxo-3-(benzylphenyl)butanoic acid of formula IV. The product is further subjected to oxidation and simultaneous decarboxylation to obtain the objective compound of formula V.  
COPYRIGHT: (C)1980,JPO&Japio

Other Abstract Info

CHEMABS 093(13)132254R

Foreign References

(No patents reference this one)



Nominate this  
invention  
for the Gallery...

Alternative  
Searches

[Patent Number](#)

[Boolean Text](#)

[Advanced Text](#)

Browse

[U.S. Class  
by title](#)

[U.S. Class  
by number](#)

[IBM Technical  
Disclosure Bulletin](#)

BEST AVAILABLE COPY

⑩ 日本国特許庁 (JP)  
⑫ 公開特許公報 (A)

⑪ 特許出願公開  
昭55—38359

⑬ Int. Cl.<sup>3</sup>  
C 07 C 59/84  
51/16

識別記号

庁内整理番号  
7457—4H

⑭ 公開 昭和55年(1980)3月17日

発明の数 1  
審査請求 有

(全 5 頁)

⑮ 2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロピオン  
酸の製造法

⑯ 特 願 昭53—112737  
⑰ 出 願 昭53(1978)9月12日  
⑱ 発 明 者 其田秩和  
大阪市西成区天下茶屋2丁目3

番 4 号  
⑲ 発 明 者 植山民男  
大阪市旭区高殿3の13の5  
⑳ 出 願 人 浜理薬品工業株式会社  
大阪市東淀川区浜町76番地  
㉑ 代 理 人 弁理士 岸本芳夫 外1名

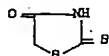
明 細 書

1. 発明の名称

2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロピオン  
酸の製造法

2. 特許請求の範囲

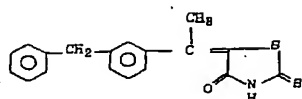
式 I



(I)

で示される 2-チオキノ-4-オキソチアゾリジンと 8-ベンジルアセトフェノンとを脱水縮合させて

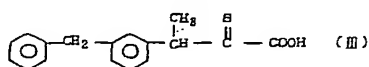
式 II



(II)

で示される 2-チオキノ-4-オキソ-5-(1-(3-ベンゾイルフェニル)-エチリデン)-チアゾリジンに導き、ついで加水分解して生成する

式 III

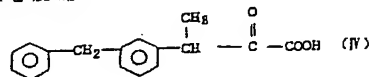


(III)

(1)

の 2-チオキノ-8-(3-ベンゾイルフェニル)-  
-ブタン酸を脱炭して

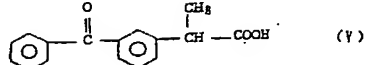
式 IV



(IV)

の 2-オキノ-8-(3-ベンゾイルフェニル)-  
-ブタン酸を得、これを酸化と同時に脱炭酸すること  
を特徴とする。

式 V



(V)

の 2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロピオン  
酸の製造法。

3. 発明の詳細な説明

本発明は 2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロ  
ピオン酸の製造法に関するものである。

本発明の目的は上記化合物の新しい製造法を提  
供するにある。

本発明の方法の目的物 2-(3-ベンゾイル  
フェニル)-プロピオン酸は抗炎症、鎮痛、解熱作  
用を示す薬剤として知られている。

本化合物の合成法としては、従来種々の方法が

(2)

BEST AVAILABLE COPY

# BEST AVAILABLE COPY

特開 昭55-38359(3)

成させる。

本加水分解反応は化合物(II)を水溶液またはアルコール溶液中で塩基と接触させることによつて行なわれる。塩基としては一般に無機塩基が用いられ、その例としては、水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化バリウムなどのアルカリ金属、アルカリ土類金属の水酸化物、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、炭酸バリウムなどのアルカリ、アルカリ土類金属の炭酸塩が挙げられる。

反応の温度、時間等の条件は使用する溶媒や塩基の種類、濃度等によつて適宜決定される。

たとえば90-100度において10-20%の水酸化ナトリウム水溶液中で加水分解する場合では1時間程度で充分反応が進行する。

生成する化合物(III)は水性アルカリ性反応混合物中においては一般に溶解しているが、酸性においては溶解度が減少するので反応混合物を、たとえば、塩酸、硫酸のような強酸の水溶液に加えて化合物(III)を結晶として析出させることができる。

(7)

過マンガン酸カリウムによる酸化は硫酸、酢酸などの酸性溶液、水酸化ナトリウム、炭酸ナトリウムなどのアルカリ性溶液及び硫酸マグネシウム、塩化マグネシウム添加の中性溶液で行なわれるが、収率がよいという点で硫酸マグネシウム添加の中性溶液が好ましい。

反応の溶媒としては普通水が用いられるが無水アセトン、ピリジンなどを用いてもよい。

反応は比較的低い温度でも進行する。たとえば苛性アルカリ水溶液に溶解した化合物(IV)に過マンガン酸カリウムを作用させる場合には、0度附近で反応させることもできる。

反応温度や反応時間は酸化剤や液性及び濃度等の条件に支配されるので実験的に決定され得る。

反応混合物中に生成する2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロピオン酸は水性溶媒から酸性で油状物として分離することができる。

以下、実施例によつて本発明をより具体的に説明するが、これらの例によつて限定されるものではない。

## 〈脱炭工程〉

前記で生成する化合物(III)を次に脱炭して新規化合物2-オキシ-3-(3-ベンジルフェニル)-プロパン酸(IV)を得る。

反応はアンモニアアルカリ性水溶液、もしくはアルコール溶液中で行なわれる。反応は通常、加熱下に比較的短時間で終了する。その温度や時間は他の条件を考慮して実験的に決定できる。水性反応混合物を酸性にすると化合物(IV)が結晶として析出させることができる。

## 〈同時酸化、脱炭酸工程〉

前記のようにして生成した化合物(IV)を酸化と同時に脱炭酸して2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロピオン酸を得る。

本反応は化合物(IV)を酸化剤で処理することにより行なわれる。

酸化剤としては、たとえば過マンガン酸カリウム、重クロム酸カリウムなどを用いることができる。そして収率がよいという点で過マンガン酸カリウムの使用が好ましい。

(8)

## 実施例

(A) 2-チオオキシ-4-オキシ-5-(1-(3-ベンジルフェニル)-エチリデン)-チアゾリジン

Dean & Stark、蒸留装置を備えつけた反応器にトルエン50gを入れ、これに3-ベンジルアセトフェノン42.0g、2-チオオキシ-4-オキシチアゾリジン26.6g、酢酸アンモニウム3.2g及び酢酸0.6gを加えて加熱し沸騰、還流せしめ縮合反応を起こさせる。縮合により生じた水はトルエンと共に蒸留し、Dean & Stark蒸留装置の還流器下部の分散器に貯めて分離する。水の生成が終了するまで反応を続ける。約7時間で反応が終了する。

反応混合物を温水洗浄したのち、トルエンを留去すると油状物が得られる。得られた油状物を冷却下しばらく放置すると2-チオオキシ-4-オキシ-5-(1-(3-ベンジルフェニル)-エチリデン)-チアゾリジンが結晶として析出するのでこれを分別し水洗する。

(9)

(10)

# BEST AVAILABLE COPY

特開 昭55-38359(5)

## (自発) 手続補正書

補正の内容

昭和53年12月29日

1. 明細書第6頁下行「フェニル」ボタン酸」を「フェニル」-ボタン酸」と補正します。

以上

特許庁長官殿

1. 事件の表示 昭和53年特許願第112737号

2. 発明の名称 2-(3-ベンゾイルフェニル)-プロピオン酸の製造法

3. 補正をする者 事件との関係 特許出願人

住 所 大阪市東淀川区浜町7B番地

浜理薬品工業株式会社

4. 代理人

住 所 大阪市東区北浜4の46 万成ビル

氏 名 (5165) 岸 本 芳 夫

5. 補正の日の付 昭和 年 月 日  
(発送日 昭和 年 月 日付)

6. 補正により増加する発明の数

7. 補正の対象 明細書中の発明の第 5.1.8 項

8. 補正の内容 別紙の通り